

PHARMACEUTICAL COMPOSITION FOR ALLERGIC DISEASE

特許公報番号 JP2002053485 (A)
公報発行日 2002-02-19
発明者: NAKAJIMA NOBORU
出願人 OSHIDA TETSUO
分類:
一国際: A61K45/06; A61K31/4402; A61K31/573; A61K35/56; A61K36/00; A61K36/18;
A61K36/23; A61K36/48; A61K36/53; A61K36/71; A61K36/75; A61K36/896; A61P11/02;
A61P11/04; A61P11/06; A61P17/04; A61P37/08; A61K45/00; A61K31/4402;
A61K31/57; A61K35/56; A61K36/00; A61K36/18; A61K36/188; A61K36/88; A61P11/00;
A61P17/00; A61P37/00; (IPC1-7): A61K35/78; A61K31/4402; A61K31/573; A61K35/56;
A61K45/06; A61P11/02; A61P11/04; A61P11/06; A61P17/04; A61P37/08
一欧州:
出願番号 JP20000239809 20000808
優先権主張番号: JP20000239809 20000808

要約 JP 2002053485 (A)

PROBLEM TO BE SOLVED: To provide a pharmaceutical composition for allergic disease, truly effective for prophylaxis, mitigation or amelioration of the allergic disease, and not causing anxiety of side effects. SOLUTION: This pharmaceutical composition for the allergic disease contains a steroid drug, an antihistaminic agent and licorice.

esp@cenet データベースから供給されたデータ — Worldwide

(19)日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11)特許出願公開番号

特開2002-53485

(P2002-53485A)

(43)公開日 平成14年2月19日(2002.2.19)

(51)Int.Cl.⁷

A 6 1 K 35/78

識別記号

F I

テ-マコ-ド*(参考)

A 6 1 K 35/78

J 4 C 0 8 4

B 4 C 0 8 6

C 4 C 0 8 7

F 4 C 0 8 8

K

審査請求 未請求 請求項の数 6 O L (全 5 頁) 最終頁に続く

(21)出願番号

特願2000-239809(P2000-239809)

(22)出願日

平成12年8月8日(2000.8.8)

(71)出願人 500370078

大信田 哲穂

愛知県名古屋市北区志賀本通1丁目38番地

(72)発明者 中島 登

石川県鹿島郡鹿西町能登部下

(74)代理人 100095832

弁理士 細田 芳徳

最終頁に続く

(54)【発明の名称】アレルギー性疾患用医薬組成物

(57)【要約】

【課題】本発明は、アレルギー性疾患の予防、緩和もしくは改善に対し真に有効で、かつ副作用の懸念のないアレルギー性疾患用医薬組成物を提供することを目的とする。

【解決手段】ステロイド剤、抗ヒスタミン剤およびカンゾウを含有してなるアレルギー性疾患用医薬組成物。

【特許請求の範囲】

【請求項1】ステロイド剤、抗ヒスタミン剤およびカンゾウを含有してなるアレルギー性疾患用医薬組成物。

【請求項2】ステロイド剤がデキサメタゾンであり、抗ヒスタミン剤がマレイン酸クロルフェニラミンである、請求項1記載の組成物。

【請求項3】さらに、牡蠣を含有してなる請求項1または2記載の組成物。

【請求項4】さらに、キジツ、キキョウ、オウレン、オウバク、サンシシ、オウゴンおよびトウキからなる群より選ばれる少なくとも1種を含有してなる、アトピー性皮膚炎のための請求項1～3いずれか記載の組成物。

【請求項5】さらに、マオウ、ブシ、サイシン、カンキョウ、レンギョウおよびシンイからなる群より選ばれる少なくとも1種を含有してなる、アレルギー性鼻炎または花粉症のための請求項1～3いずれか記載の組成物。

【請求項6】さらに、ハンゲ、バクモンドウ、サイシン、カンキョウ、ゴミシおよびキキョウからなる群より選ばれる少なくとも1種を含有してなる、アレルギー性気管支炎または喘息のための請求項1～3いずれか記載の組成物。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は、アレルギー性疾患用医薬組成物に関する。

【0002】

【従来の技術】近年、アレルギー性疾患の罹患者数は増加の一途を辿っており、特に花粉症とアトピー性皮膚炎の罹患者の増加は著しいものがある。抗原の増加のみならず、大気汚染や食品添加物、食生活の変化といった周囲の環境の変化が、アレルギーの増加の原因であると推定されている。

【0003】アレルギー性疾患は外部抗原に対する生体側の過剰防衛反応であり、抗体産生細胞等の過剰対応が原因であるとされている。すなわち、人体の持つ抵抗力の過剰反応ということができる。

【0004】このようなアレルギー性疾患の治療では、従来、抗ヒスタミン剤やステロイド剤等の投与が対症療法的に行われてきた。しかしながら、これらの薬剤を用いても充分な効果は得られず、また副作用が強く、安全性の点でも問題があった。

【0005】

【発明が解決しようとする課題】本発明は、アレルギー性疾患の予防、緩和もしくは改善に対し真に有効で、かつ副作用の懸念のないアレルギー性疾患用医薬組成物を提供することを目的とする。

【0006】

【課題を解決するための手段】本発明者は鋭意検討した結果、ステロイド剤、抗ヒスタミン剤およびカンゾウを

含有してなる組成物が所望の効果を発現し得ることを見出し、本発明を完成するに至った。

【0007】即ち、本発明は、(1)ステロイド剤、抗ヒスタミン剤およびカンゾウを含有してなるアレルギー性疾患用医薬組成物、(2)ステロイド剤がデキサメタゾンであり、抗ヒスタミン剤がマレイン酸クロルフェニラミンである、請求項1記載の組成物、(3)さらに、牡蠣を含有してなる前記(1)または(2)記載の組成物、(4)さらに、キジツ、キキョウ、オウレン、オウバク、サンシシ、オウゴンおよびトウキからなる群より選ばれる少なくとも1種を含有してなる、アトピー性皮膚炎のための請求項1～3いずれか記載の組成物。

10 (5)さらに、マオウ、ブシ、サイシン、カンキョウ、レンギョウおよびシンイからなる群より選ばれる少なくとも1種を含有してなる、アレルギー性鼻炎または花粉症のための前記(1)～(3)いずれか記載の組成物、(6)さらに、ハンゲ、バクモンドウ、サイシン、カンキョウ、ゴミシおよびキキョウからなる群より選ばれる少なくとも1種を含有してなる、アレルギー性気管支炎または喘息のための前記(1)～(3)いずれか記載の組成物、ならびに(7)さらに、ハンゲ、バクモンドウ、サイシン、カンキョウ、ゴミシおよびキキョウからなる群より選ばれる少なくとも1種を含有してなる、アレルギー性鼻炎または花粉症のための前記(1)～(3)いずれか記載の組成物、に関する。

【0008】

【発明の実施の形態】本発明にいう「抗アレルギー」とは、あらゆるアレルギー性疾患の予防、緩和もしくは改善に機能し得るということを意図するものである。また、「改善」とは治療の意を含むものである。

【0009】前記アレルギー性疾患とは、一般に、アレルギー、即ち免疫反応の病的過程の結果生ずる疾患であると定義されている。アレルギーは、その発症機序からI型、II型、III型とIV型とに分類されている。I型はIgEクラスの抗体、II型はIgGおよびIgMクラスの抗体、III型は免疫複合体、IV型は感作リンパ球が、それぞれ特異的な免疫反応因子である。例えば、I型アレルギー反応には気管支炎、喘息、花粉症、枯草熱、蕁麻疹、アレルギー性鼻炎や昆虫アレルギーが、II型アレルギー反応には血液型不適合溶血性貧血、アレルギー性血小板、白血球減少症、グッドパスチャーリー症候群等が、III型アレルギー反応にはアルサス反応、血清病、各種糸球体腎炎等が、IV型アレルギー反応には接触性皮膚炎、ツベルクリン反応が挙げられる。また、遺伝的素因による傾向が強い、アトピー性皮膚炎やアトピー性鼻炎等のアトピー性疾患も含まれる。

【0010】本発明においては、なかでも、アレルギー性鼻炎、アレルギー性気管支炎、喘息、花粉症およびアトピー性皮膚炎からなる群より選ばれる少なくとも1種の予防、緩和もしくは改善に該組成物を使用するのが好みである。

【0011】また、本発明の組成物は、アレルギー性疾患として他に、風邪の諸症状の予防、緩和もしくは改善に対しても有効であり、例えば、風邪に伴う炎症、のど

のはれ、せき、鼻汁、鼻づまり等の予防、緩和もしくは改善に該組成物を使用するのが好ましい。

【0012】本発明の組成物は、ステロイド剤、抗ヒスタミン剤およびカンゾウを含有してなることに1つの大きな特徴を有しており、具体的な作用機序は未だ明らかではないが、個々の成分の効果が相乗的に高められることから、抗アレルギー作用が有意に増強されるものと推定される。

【0013】前記ステロイド剤としては、たとえば、酢酸コルチゾン、ヒドロコルチゾン、コハク酸ヒドロコルチゾンナトリウム、プレドニゾロン、メチルプレドニゾロン、コハク酸メチルプレドニゾロンナトリウム、トリアムシノロン、トリアムシノロンアセトニド、デキサメタゾン、パルミチン酸デキサメタゾン、ベタメタゾン、酢酸パラメタゾン、酢酸フルドロコルチゾン、酢酸ハロプレドン等を挙げることができる。これらは、単独でまたは2種以上混合して用いることができる。なかでも、本発明の所望の効果を得る観点からデキサメタゾンが好ましい。

【0014】前記デキサメタゾンとは強力な抗炎症、抗アレルギー作用を持つ合成グルココルチコイドであり、従来、膠原病、気管支炎、喘息、アトピー性疾患等の難治性の疾患の治療に用いられている薬剤である。しかしながら、胃潰瘍、副腎萎縮等の重篤な副作用を発現することが知られており、使用の制限がある。本発明の組成物においては、個々の成分の相乗効果により、副作用の懸念のない使用範囲で充分にその作用効果を発現させることができ。デキサメタゾンは、例えば、市販のものを粉末にして使用すればよい。

【0015】前記抗ヒスタミン剤としては、エタノールアミン系とプロピルアミン系のものが好ましく、たとえば、エタノールアミン系のものとしては、ジフェンヒドラミン、塩酸ジフェニルピラリン、テオクル酸ジフェニルピラリン、フマル酸クレマスチン、ジメンヒドリナート等が挙げられ、プロピルアミン系のものとしては、マレイン酸クロルフェニラミン等を挙げることができる。これらは、単独でまたは2種以上混合して用いることができる。なかでも、本発明の所望の効果を得る観点からプロピルアミン系のものが好ましく、さらにマレイン酸クロルフェニラミンが特に好ましい。

【0016】前記マレイン酸クロルフェニラミンは、従来、風邪薬として用いられている薬剤であり、例えば、市販のものを使用することができる。

【0017】前記カンゾウとは、鎮痛、鎮咳等の作用を有する漢方薬であり、種々の症状の治療に用いられている薬剤である。なお、カンゾウは古くから用いられており、安全性に関する懸念は極めて少ない。カンゾウは、その乾燥物をそのまま用いることができる。

【0018】本発明の組成物における各成分の含有量としては、ステロイド剤が好ましくは5～10重量%、よ

り好ましくは6～9重量%、抗ヒスタミン剤が好ましくは20～60重量%、より好ましくは30～50重量%、カンゾウが好ましくは5～50重量%、より好ましくは10～40重量%である。

【0019】本発明の組成物においては、前記3成分に加えさらに牡蠣を含有させるのが好ましい。

【0020】前記牡蠣とは、かきの貝殻を焼いて製した粉末である。鎮静、鎮痛、収斂、解熱等の作用を有する漢方薬であり、従来、顔面紅潮、頭部の熱感、不眠、動悸、発熱疾患後の微熱などで体の衰弱がある者等の治療に用いられている薬剤である。なお、牡蠣は古くから用いられており、安全性に関する懸念は極めて少ない。

【0021】前記カンゾウ同様、牡蠣についても、乾燥物を用いることができる。

【0022】本発明の組成物における牡蠣の含有量としては、好ましくは5～20重量%、より好ましくは10～15重量%である。

【0023】また本発明の組成物においては、さらに、〔1〕キジツ、キキョウ、オウレン、オウバク、サンシン、オウゴンおよびトウキからなる群より選ばれる少なくとも1種を用いることが、アトピー性皮膚炎の予防、緩和もしくは改善の観点から好ましい。これらの成分は古くから用いられている漢方薬であり、抗炎症、抗菌、抗ウイルス、抗真菌等の作用を有することが知られている。また、安全性に関する懸念も極めて少ない。前記カンゾウ同様、これらの成分についても、乾燥物を用いることができる。

【0024】また同様に、本発明の組成物においては、さらに、〔2〕マオウ、ブシ、サイシン、カンキョウ、レンギョウおよびシンイからなる群より選ばれる少なくとも1種を用いることが、アレルギー性鼻炎または花粉症の予防、緩和もしくは改善の観点から好ましい。これらの成分は古くから用いられている漢方薬であり、循環促進、健胃、抗菌、消炎、抗ウイルス、利尿等の作用を有することが知られている。また、安全性に関する懸念も極めて少ない。前記カンゾウ同様、これらの成分についても、乾燥物を用いることができる。

【0025】また同様に、本発明の組成物においては、さらに、〔3〕ハンゲ、バクモンドウ、サイシン、カンキョウ、ゴミシおよびキキョウからなる群より選ばれる少なくとも1種を用いることが、アレルギー性気管支炎または喘息の予防、緩和もしくは改善の観点から好ましい。これらの成分は古くから用いられている漢方薬であり、去虚、鎮咳、抗菌、消炎、鎮静等の作用を有することが知られている。また、安全性に関する懸念も極めて少ない。前記カンゾウ同様、これらの成分についても、乾燥物を用いることができる。

【0026】これらの各症状に合わせて用いることが好ましい漢方薬〔1〕～〔3〕として列挙する成分の本発明の組成物における含有量は、所望の効果が得られるよ

うに適宜調節すればよいが、例えば、かかる成分の合計量は〔1〕～〔3〕のいずれの群においても好ましくは5～15重量%、より好ましくは5～10重量%である。

【0027】本発明の組成物の剤型は特に限定されるものではなく、前記例示した各成分のみを単に混和して、あるいは一般に製剤上許容され得る1種以上のベヒクル、担体、賦形剤、結合剤、防腐剤、安定剤、矯味矯臭剤、コーティング剤、着色剤、糖衣剤、崩壊剤、增量剤、滑沢剤等と共に混和して、粉末剤、錠剤、散剤、顆粒剤、カプセル剤、水薬等の経口投与剤とすることができ、特に粉末剤が好ましい。これらは、前記各成分を配合する以外は、従来公知の技術を用いて製造することができる。

【0028】このような本発明の組成物の好適な投与量*

成人(1人当たり)1日分処方(薬剤3500mgを1日に3回に分けて投与)

*は、疾患の種類、症状、患者の年令、性別、体重等により異なるが、成人1人1日当たり、2000～3500mgが適当である。

【0029】本発明の組成物は、あらゆるアレルギー性疾患の予防、緩和もしくは改善に有効であり、アレルギー性疾患の治療薬もしくは化粧料等として用いることができる。

【0030】

【実施例】以下、本発明を実施例により具体的に説明するが、本発明は実施例のみに限定されるものでない。

【0031】実施例1

表1の配合〔(1)～(4)〕に従って常法により各成分を混合し粉末剤を得た。

【0032】

【表1】

| 成分 | 配合量(重量%) | | | |
|----------------|----------|------|------|------|
| | (1) | (2) | (3) | (4) |
| デキサメタゾン | 7.2 | 7.2 | 6.5 | 7.2 |
| マレイン酸クロルフェニラミン | 32.0 | 22.6 | 32.0 | 32.0 |
| カンゾウ | 32.0 | 15.6 | 14.7 | 15.0 |
| 牡丹 | 15.6 | — | — | 9.4 |
| キヅツ | 7.8 | 7.8 | 7.8 | — |
| キキョウ | 7.8 | — | 7.8 | — |
| トウキ | — | — | — | 7.8 |
| マオウ | — | 7.8 | — | — |
| ブシ | — | 7.8 | — | 7.8 |
| サイシン | — | 7.8 | — | 7.8 |
| カンキョウ | — | 7.8 | 7.8 | 7.8 |
| レンギョウ | — | 7.8 | — | — |
| シンイ | — | 7.8 | — | — |
| ハング | — | — | 7.8 | — |
| バクモンドウ | — | — | 7.8 | — |
| ゴミシ | — | — | 7.8 | 7.8 |

【0033】実施例2

常法に従い、前記表1の配合〔(1)～(4)〕に従う各成分と適量の乳糖およびステアリン酸マグネシウムとを混合し、この混合物を単発式打錠機にて打錠し、錠剤を製造する。

【0034】実施例3

実施例2で得た錠剤を粉碎、製粒し、篩別して顆粒剤を製造する。

【0035】治療例1

以下に示す治療例は、基本的に病院で6カ月以上治療して改善の認められなかった患者を対象としたものであ

る。

【0036】(1)アトピー性皮膚炎

34才男性。表1の(1)に示す薬剤を1日3回、7日間投与した時点で痒み、赤味の軽減がみられ、28日位でほとんど消失した。以後、自覚症状に応じて頓服的に薬剤を投与し、予防、治療に努めている。

【0037】(2)アレルギー性鼻炎

58才男性。長年アレルギー性鼻炎の症状で、もう治らないとあきらめていた患者。表1の(2)に示す薬剤を1日3回、14日間投与した時点で症状はほとんど消失したが、元の症状の再発を恐れ、現在も頓服的に使用し

ている。風邪をひきやすかったが、現在は風邪もひかなくなり、体調良好である。

【0038】(3)アレルギー性気管支炎

54才女性。季節変わりに必ずのどがいがらっぽくなり、咳がとまらなくなる患者。表1の(3)に示す薬剤を1日3回、7日間投与した時点では症状が軽減し、14日位でほとんど消失した。現在は季節変わりに1日1回(1/3量)で予防的に使用している。

【0039】(4)喘息

59才男性。長年喘息で苦しみ、夜も眠れないことがあった患者。表1の(3)に示す薬剤を1日3回、10日間投与した時点では緩解がみられ、30日位で消失した。以後、1日2回(2/3量)で30日、1日1回(1/*

*3量)で30日と減量し、調子によって自分で加減して継続して使用している。前記(2)の患者と同様に風邪をひきにくくなつた。

【0040】(5)花粉症

52才女性。毎年2月下旬から症状が出るので、同じ時期に必ず来局する患者。表1の(2)に示す薬剤を1日1回(1/3量)の投与で鼻水、鼻づまりなどの症状が軽減した。

【0041】

【発明の効果】本発明により、副作用の懸念なく効果的にアレルギー性疾患の予防、緩和もしくは改善を行うことができるアレルギー性疾患用医薬組成物が提供される。

フロントページの続き

(51) Int.Cl.

A 61 K 35/78

識別記号

F I

マーク(参考)

A 61 K 35/78

N

Q

V

31/4402

31/4402

31/573

31/573

35/56

35/56

45/06

45/06

A 61 P 11/02

A 61 P 11/02

11/04

11/04

11/06

11/06

17/04

17/04

37/08

37/08

F ターム(参考) 4C084 AA23 MA02 MA17 MA35 MA37

MA41 MA43 MA52 MA63 NA14

ZA591 ZA891 ZB131 ZC081

ZC131

4C086 AA01 AA02 BC17 DA10 MA03

MA04 MA63 NA14 ZA59 ZA89

ZB13 ZC08 ZC13 ZC75

4C087 AA01 AA02 BB16 MA02 MA63

NA14 ZA34 ZA59 ZA89 ZB13

ZC08 ZC13 ZC75

4C088 AB12 AB14 AB30 AB32 AB38

AB41 AB60 AB62 AB64 AB65

AB80 AB81 AB85 AC01 MA02

MA08 MA63 NA14 ZA59 ZA89

ZB13 ZC08 ZC13